

## 2-Substituierte Pyrimidine

## Beschreibung

5 Die Erfindung betrifft 2-substituierte Pyrimidine der Formel I,



in der der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

10 n eine ganze Zahl von 1 bis 5;

15 L Halogen, Cyano, Cyanato (OCN), C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyloxy, C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyloxy, Nitro, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A') (=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)<sub>m</sub>-A, S(=O)<sub>m</sub>-O-A oder S(=O)<sub>m</sub>-N(A')A,

m 0, 1 oder 2;

20 A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkenyl, Phenyl, wobei die organischen Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder durch Nitro, Cyanato, Cyano oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiert sein können; oder A und A' zusammen mit den Atomen an die sie  
25 gebunden sind für einen fünf- bis sechsgliedrigen gesättigten, partiell ungesättigten oder aromatischen Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, stehen;

30 wobei die aliphatischen Gruppen der Restdefinitionen von L ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis vier Gruppen R<sup>u</sup> tragen können:

35 R<sup>u</sup> Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyloxy, C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyloxy, C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyloxy, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A') (=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)<sub>m</sub>-A, S(=O)<sub>m</sub>-O-A oder S(=O)<sub>m</sub>-N(A')A;

$R^1$ ,  $R^2$  unabhängig voneinander  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkynyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Halogenycycloalkyl, wobei die aliphatischen Gruppen der Restdefinitionen von  $R^1$  und  $R^2$  ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis vier Gruppen  $R^v$  tragen können:

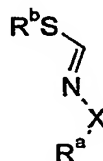
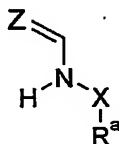
$R^v$  Cyano,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_4$ - $C_6$ -Cycloalkenyl, Hydroxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyloxy,  $C_2$ - $C_6$ -Alkinyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyloxy,  $C_4$ - $C_6$ -Cycloalkenyloxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $-C(=O)-A$ ,  $-C(=O)-O-A$ ,  $-C(=O)-N(A')A$ ,  $C(A')(=N-OA)$ ,  $N(A')A$ ,  $N(A')-C(=O)-A$ ,  $N(A'')-C(=O)-N(A')A$ ,  $S(=O)_m-A$ ,  $S(=O)_m-O-A$  oder  $S(=O)_m-N(A')A$  oder Phenyl, wobei der Phenylteil ein bis drei Reste ausgewählt aus der Gruppe: Halogen,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkynyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy, Cyano, Nitro,  $-C(=O)-A$ ,  $-C(=O)-O-A$ ,  $-C(=O)-N(A')A$ ,  $C(A')(=N-OA)$ ,  $N(A')A$  tragen kann;

$R^2$  kann zusätzlich Wasserstoff bedeuten;

$R^1$  und  $R^2$  können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch eine Ether  $-(O-)$ , Carbonyl  $-(C=O)-$ , Thio  $-(S-)$ , Sulfoxyl  $-(S[=O]-)$  oder Sulfenyl  $-(SO_2-)$  oder eine weitere Amino  $-(N(R^a)-)$  Gruppe, wobei  $R^a$  Wasserstoff oder  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl bedeutet, unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl und Oxy- $C_1$ - $C_3$ -alkylenoxy enthalten kann;

$R^3$  Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_4$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_4$ -Alkynyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_3$ - $C_4$ -Alkenyloxy,  $C_3$ - $C_4$ -Alkinyloxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio, Di- $(C_1$ - $C_6$ -alkyl)amino oder  $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino, wobei die Alkyl, Alkenyl und Alkynylreste von  $R^3$  durch Halogen, Cyano, Nitro,  $C_1$ - $C_2$ -Alkoxy oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxycarbonyl substituiert sein können;

$R^4$  einer der Formeln



entspricht, in denen

- X eine direkte Bindung,  $-(C=O)-$ ,  $-(C=O)-NH-$ ,  $-(C=O)-O-$ ,  $-O-$ ,  $-NR^c-$ , wobei der jeweils linke Molekülteil an das Stickstoffatom gebunden ist;
- 5  $R^a$  Wasserstoff, Methyl, Benzyl, Trifluormethyl, Allyl, Propargyl oder Methoxymethyl;
- $R^b$  Wasserstoff,  $C_1-C_6$ -Alkyl,  $C_2-C_6$ -Alkynyl;
- 10  $R^c$  Wasserstoff, Methyl oder  $C_1-C_4$ -Acyl
- Z S oder  $NR^b$ ;  
bedeuten,  
wobei die aliphatischen Gruppen der Restdefinitionen von  $R^a$ ,  $R^b$  und/oder  
15  $R^c$  ihrerseits eine oder zwei Gruppen  $R^w$  tragen können:
- $R^w$  Halogen,  $OR^x$ ,  $NHR^x$ ,  $C_1-C_6$ -Alkyl,  $C_1-C_4$ -Alkoxycarbonyl,  $C_1-C_4$ -  
Acylamino, [1,3]Dioxolane- $C_1-C_4$ -alkyl, [1,3]Dioxane- $C_1-C_4$ -alkyl, wo-  
bei
- 20  $R^x$  Wasserstoff, Methyl, Allyl oder Propargyl bedeutet.

Außerdem betrifft die Erfindung ein Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie  
25 enthaltende Mittel sowie deren Verwendung zur Bekämpfung pflanzenpathogener  
Schadpilze.

Aus WO-A 01/96314 sind fungizide Pyrimidine, die in 2-Stellung einen Cyanamino-  
substituenten tragen, bekannt. Weiterhin sind aus WO-A 03/43993 fungizide Pyrimidine  
30 bekannt, die in 2-Stellung unter anderem einen Amidrest tragen.

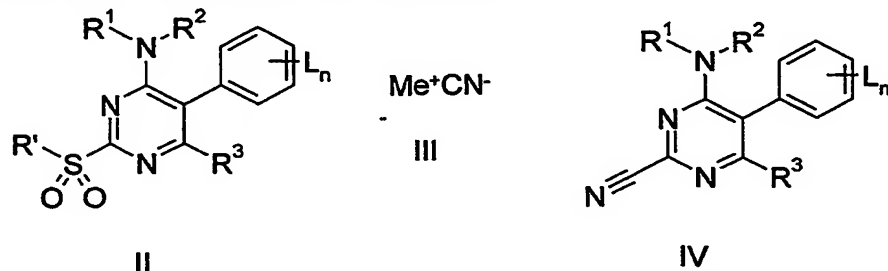
Die Wirkung der o.g. Pyrimidine ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Da-  
her lag als Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirksamkeit zu finden.

Demgemäß wurden die eingangs definierten Pyrimidine der Formel I gefunden. Außer-  
35 dem wurden Verfahren zu ihrer Herstellung sowie sie enthaltende Mittel zur Bekämp-  
fung von Schadpilzen gefunden.

Die Verbindungen I können auf verschiedenen Wegen erhalten werden.

Beispielsweise kann von den Sulfonen der Formel II ausgegangen werden, deren Herstellung in WO-A 02/074753 oder DE 10156279.9 detailliert beschrieben ist und R' für einen ggf. subst. C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyrest oder einen ggf. subst. Phenylrest steht. Durch Umsetzung der Sulfone II mit Metallcyaniden III (Me<sup>+</sup>CN<sup>-</sup>) werden die Nitrile IV gewonnen.

- 5 Unter Metallcyaniden sind in erster Linie Alkali- oder Erdalkalicyanide oder auch kovalente Cyanide wie Zinntetracyanid zu verstehen.

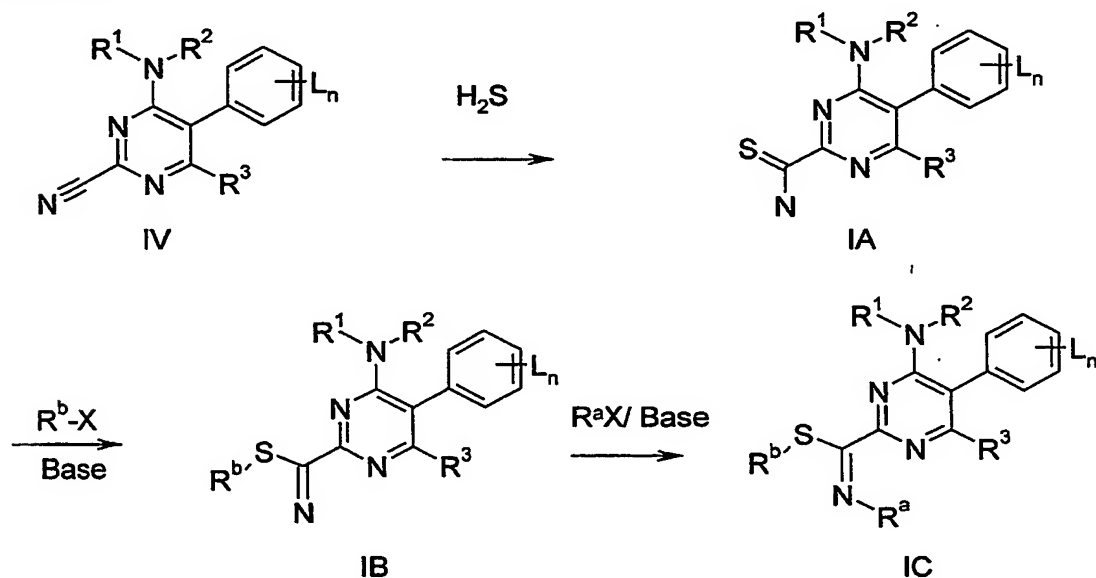


Der Austausch der Sulfonatgruppe gegen die Nitrilgruppe erfolgt nach literaturbekannten Methoden wie sie beispielsweise in WO-A 03/043993 beschrieben sind.

10

Die weitere Synthese kann wie in Schema 1 dargestellt erfolgen:

Schema 1:

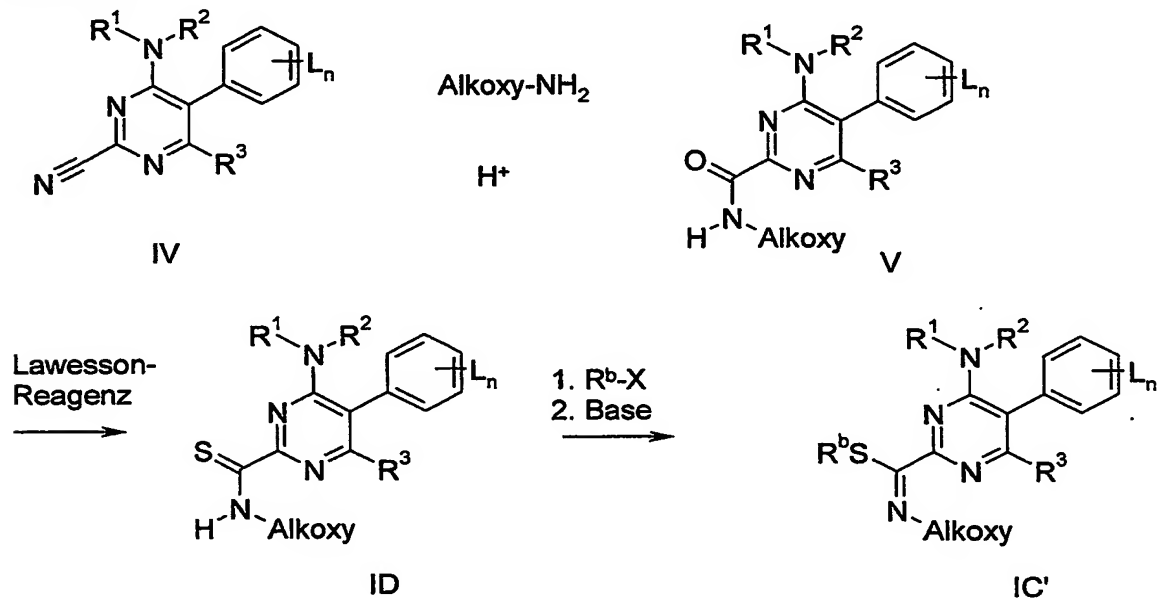


- 15 Die Nitrilverbindung IV kann mit Schwefelwasserstoff unter vorzugsweise sauren Bedingungen zum Thioamid IA thiolysiert werden. Die Thiolyse erfolgt unter den Bedingungen der Pinner-Reaktion (s. Herstellbeispiele). Die Alkylierung mit R<sup>b</sup>-X, wobei R<sup>b</sup> die eingangs erwähnte Bedeutung hat und X für eine Abgangsgruppe wie Halogenid, Sulfat oder Sulfonat steht, liefert Verbindungen des Typs IB. Ein weiterer Alkylierungsschritt mit R<sup>a</sup>-X, wobei R<sup>a</sup> für beispielsweise C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl und X für eine Abgangsgruppe wie Halogenid, Sulfat oder Sulfonat steht, führt zu Verbindungen des Typs IC.
- 20

Die beiden oben erwähnten Alkylierungen können auch mit Meerwein Salzen der Formel  $(R^b)_3OBF_4$  analog den in Synth. Commun., 1983, 13, S. 753 oder Helv. Chim. Acta, 1986, 69, S. 1224 aufgeführten Vorschriften durchgeführt werden.

- 5 Die erfindungsgemäßen Verbindungen IC', in denen  $R^a$  für einen  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy substituenten steht, sind wie in Schema 2 aufgeführt, zugänglich.

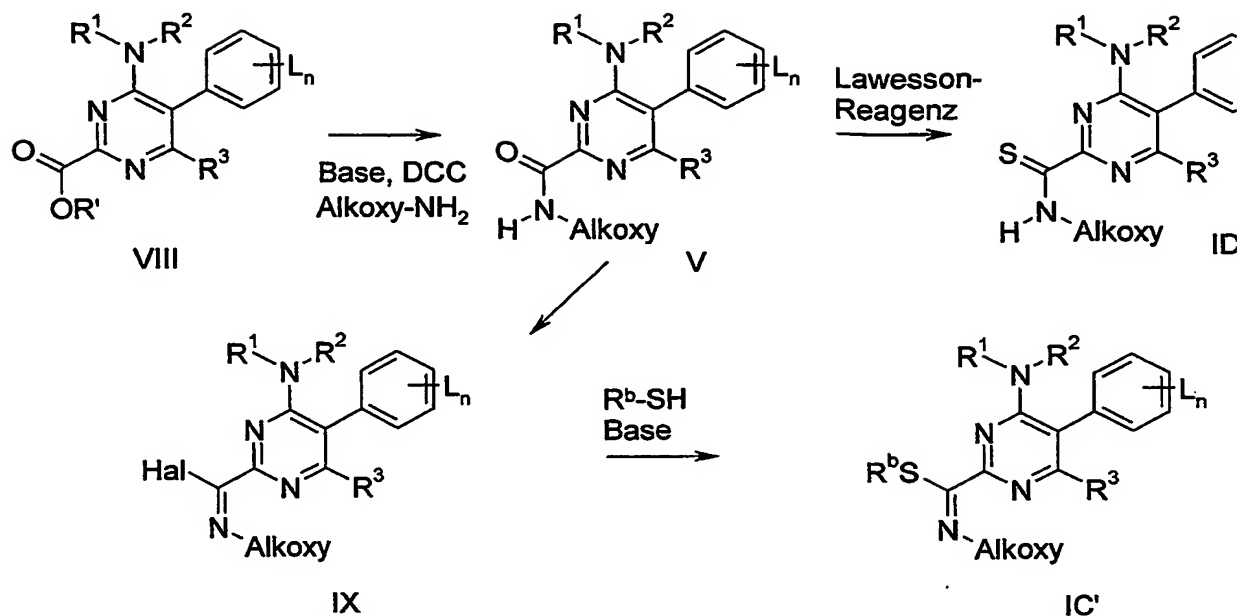
Schema 2:



- 10 Ausgehend vom Nitril IV wird mit  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxyamin unter sauren Bedingungen das Hydroxamsäurederivat V gewonnen. Die Umwandlung in die Thionverbindung ID kann beispielsweise mit Phosphorpentasulfid oder Lawesson-Reagenz erfolgen. Durch Alkylierung mit  $R^b$ -X, wobei  $R^b$  die zuvor genannte Bedeutung hat und X für eine Abgangsgruppe wie Halogenid, Sulfonat oder Sulfat steht, können die erfindungsgemäßen Verbindungen IC gewonnen werden.
- 15

Eine alternative Synthese der erfindungsgemäßen Verbindungen IC' und ID ist in Schema 3 aufgeführt.

Schema 3:



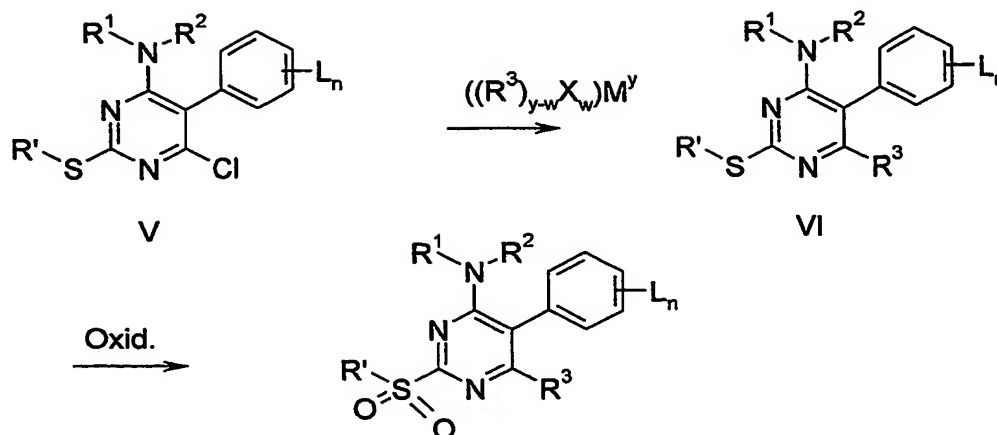
- 5 Die in Schema 3 aufgeführte Synthese der Verbindungen IC' und ID geht vom Ester der Formel VIII aus. Die Umsetzung von VIII mit Hydroxylaminen zu den Hydroxamsäuren V kann wie in Org.Lett., 2001, Vol 3, S. 1053-56 oder in J.Org.Chem., 2000, Vol 85, S. 8415-20 beschrieben, durchgeführt werden. Die anschließende Schwefelung kann analog zu Aust.J.Chem., 1988, Vol. 41, S. 37 erfolgen. Die Iminhalogenide der
- 10 Formel IX, wobei Hal für Halogen und insbesondere Chlor und Brom steht, sind analog Synthesis, 1991, Vol 9, S. 750-752 zugänglich. In einer Appel Reaktion werden beispielsweise mit Tetrabromkohlenstoff und Triphenylphosphin die entsprechenden Bromverbindungen hergestellt. Letztere lassen sich schließlich mit Merkaptanen der Formel  $R^b\text{SH}$  und Basen zu den erfindungsgemäßen Verbindungen IC' umsetzen.

15

Der Rest  $R^3$  (insbesondere Alkyl) in 6-Position am Pyrimidinring kann durch Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse eingeführt werden. In manchen Fällen kann es ratsam sein die Reihenfolge umzudrehen und den Substituenten  $R^3$  vor dem Substituenten  $\text{NR}^1\text{R}^2$  einzuführen.

20

Schema 4:



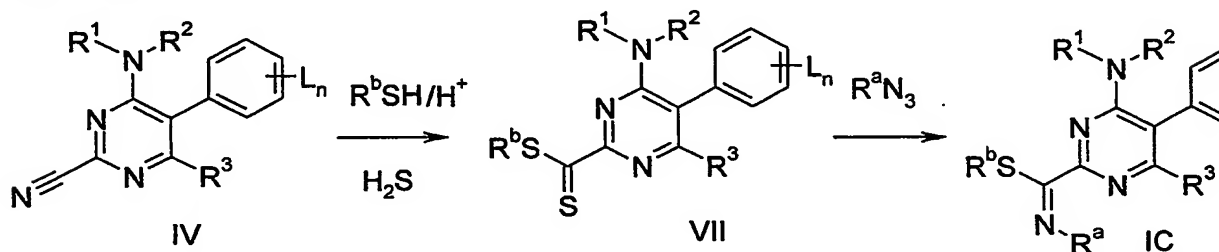
In Formel  $(R^3)_{y-w}X_wM^y$  steht M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn, Mg, Cu oder Sn, X steht für Chlor, Brom, Iod oder Hydroxy,  $R^3$  bedeutet bevorzugt C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und w steht für eine Zahl von 0 bis 3. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996); WO-A 99/41255; Aust. J. Chem., Bd. 43, 733 (1990); J. Org. Chem., Bd. 43, 358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979); Tetrahedron Lett., Bd. 34, 8267 (1993); ebenda, Bd. 33, 413 (1992). R' bedeutet in den o.g. Formeln insbesondere ggf. subst. C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder ggf. subst. Phenyl.

Pyrimidine, die in 2-Stellung einen Rest  $R^4$  tragen:



wobei  $R^a$  Alkyl, Alkenyl, Alkynyl oder Cycloalkyl bedeutet, können beispielsweise auch nach den folgenden Synthesewegen hergestellt werden.

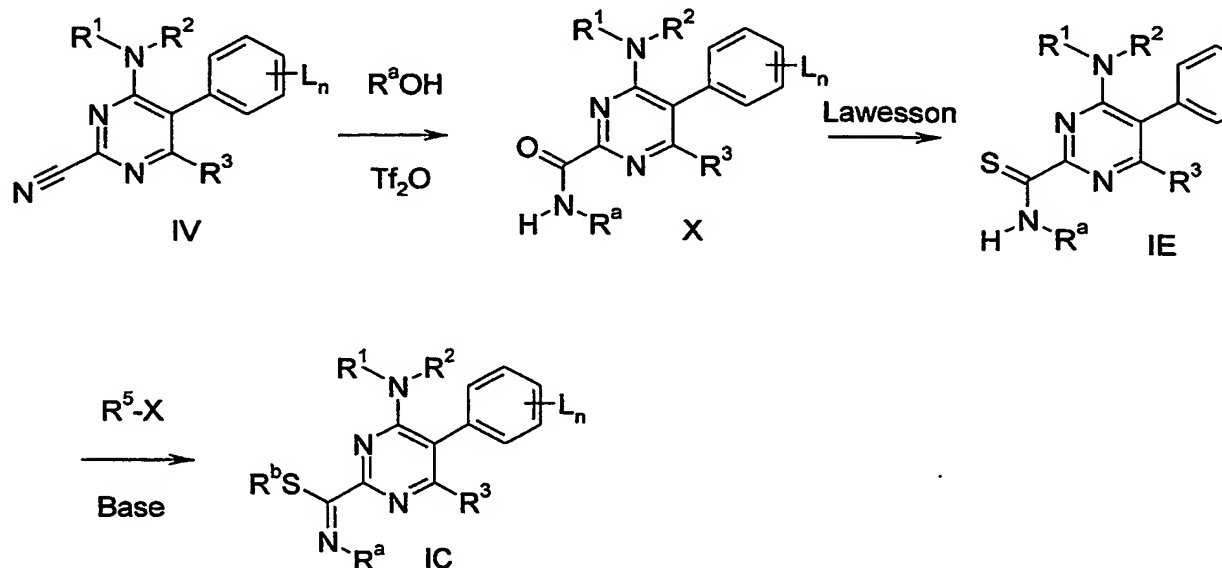
Schema 5:



Wie in Schema 5 gezeigt können die zuvor beschriebenen Nitrile IV mit Merkaptanen  $R^bSH$ , wobei  $R^b$  die eingangs gegebene Bedeutung hat unter sauren Bedingungen umgesetzt werden (s. Chem.Ber., 1980, Vol 113, S. 1898). In einer weiteren Umset-

zung mit Aziden kann der Rest  $R^a$ -N, wobei  $R^a$  die eingangs erwähnte Bedeutung hat, eingeführt werden (s. Pol.J.Chem., 2001, Vol 75, S.975-82).

Schema 6:



5

In Schema 6 ist eine alternative Syntheseroute zu den erfindungsgemäßen Verbindungen IC aufgezeigt. Ausgehend von den Nitrilen der Formel IV wird in einer modifizierten Ritter Reaktion mittels Alkoholen der Formel  $R^a-OH$  und Trifluoressigsäureanhydrid die Amide der Formel X gewonnen (s. Tetrahedron Lett., 1989, Vol 30, S 581-82). Die Schwefelung mit Lawesson Reagenz kann nach der in J.Labelled Compd.Rad., 1988, Vol 25, S. 335-343 beschriebenen Methode durchgeführt werden. Die Alkylierung mit  $R^5-X$  schließlich erfolgt nach literaturüblichen Methoden, wie beispielsweise in Heterocycles, 1985, Vol 23, S. 2213-15 beschrieben.

15

Die obengenannten Angaben beziehen sich insbesondere auf die Herstellung von Verbindungen, in denen  $R^3$  eine Alkylgruppe darstellt. Sofern  $R^3$  eine Cyangruppe oder einen Alkoxy substituenten bedeutet, kann der Rest  $R^3$  durch Umsetzung mit Alkalimetallcyaniden bzw. Alkalimetallalkoholaten eingeführt werden.

20

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

25 **Halogen:** Fluor, Chlor, Brom und Jod;



- Alkyl:** gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;
- Halogenalkyl:** geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl oder 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;
- Alkenyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

**Alkadienyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und zwei Doppelbindungen in beliebiger Position;

5 **Halogenalkenyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

10 **Alkinyl:** geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

20

**Cycloalkyl:** mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl;

25 fünf- bis sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyc-  
lus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S:

- **5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl**, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isloxazolidinyl, 4-Isloxazolidinyl, 5-Isloxazolidinyl, 3-Isythiazolidinyl, 4-Isythiazolidinyl, 5-Isythiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl, 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofur-2-yl, 2,3-Dihydrofur-3-yl, 2,4-Dihydrofur-2-yl, 2,4-Dihydrofur-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-

30

35

40

- yl, 2,4-Dihydrothien-3-yl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Isoxazolin-3-yl, 3-Isoxazolin-3-yl, 4-Isoxazolin-3-yl, 2-Isoxazolin-4-yl, 3-Isoxazolin-4-yl, 4-Isoxazolin-4-yl, 2-Isoxazolin-5-yl, 3-Isoxazolin-5-yl, 4-Isoxazolin-5-yl, 2-Isotiazolin-3-yl, 3-Isotiazolin-3-yl, 4-Isotiazolin-3-yl, 2-Isotiazolin-4-yl, 3-Isotiazolin-4-yl, 4-Isotiazolin-4-yl, 2-Isotiazolin-5-yl, 3-Isotiazolin-5-yl, 4-Isotiazolin-5-yl, 2,3-Dihydropyrazol-1-yl, 2,3-Dihydropyrazol-2-yl, 2,3-Dihydropyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-3-yl, 3,4-Dihydropyrazol-4-yl, 3,4-Dihydropyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 2-Piperidiny, 3-Piperidiny, 4-Piperidiny, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyrany, 4-Tetrahydropyrany, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridaziny, 4-Hexahydropyridaziny, 2-Hexahydropyrimidiny, 4-Hexahydropyrimidiny, 5-Hexahydropyrimidiny, 2-Piperaziny, 1,3,5-Hexahydrotriazin-2-yl und 1,2,4-Hexahydrotriazin-3-yl;
- 20 - **5-gliedriges Heteroaryl**, enthaltend ein bis vier **Stickstoffatome** oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isotiazolyl, 4-Isotiazolyl, 5-Isotiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl;
- 30 - **6-gliedriges Heteroaryl**, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridiny, 3-Pyridiny, 4-Pyridiny, 3-Pyridaziny, 4-Pyridaziny, 2-Pyrimidiny, 4-Pyrimidiny, 5-Pyrimidiny, 2-Pyraziny, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl;
- 35

In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die @- und (S)-Isomere und die Racemate von Verbindungen der Formel I eingeschlossen, die chirale Zentren aufweisen.

Im folgenden werden die Ausführungsformen der Erfindung genauer beschrieben.

- Im Hinblick auf die bestimmungsgemäße Verwendung der Pyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in  
 5 Kombination, besonders bevorzugt:

Verbindungen I werden bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl und R<sup>2</sup> für Wasserstoff stehen.

- 10 Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für in  $\alpha$ -Stellung verzweigtes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl steht.

Daneben werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl und R<sup>2</sup> für Wasserstoff stehen.

- 15 Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoff, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Sauerstoffatom unterbrochen sein kann und einen oder zwei C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsubstituenten tragen kann.

- 20 Insbesondere bevorzugt sind Gruppen NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> wie – insbesondere in  $\alpha$ -Stellung – methylierte Pyrrolidine oder Piperidine. Weiterhin ist 4-Methylpiperidin bevorzugt.

- 25 Außerdem werden Pyrimidine I besonders bevorzugt, wobei der Index n und die Substituenten L<sup>1</sup> bis L<sup>5</sup> die folgende Bedeutung haben:

n 1 bis 3

- 30 L Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkynyloxy, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')=(N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A oder S(=O)<sub>m</sub>-A;

m 0, 1 oder 2;

- 35 A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, wobei die organischen Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder durch Cyano oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiert sein können, oder A und A' zusammen mit den Atomen, an die sie gebunden sind für einen fünf- bis sechsgliedrigen gesättigten He-

terocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N, oder S, stehen.

Insbesondere werden Pyrimidine I bevorzugt, wobei die Substituenten  $L^1$  bis  $L^5$  die folgende Bedeutung haben:

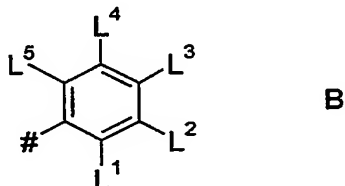
$L$  Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $-C(=O)-O-A$ ,  $-C(=O)-N(A')A$ ,

$A, A', A''$  unabhängig voneinander Wasserstoff,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkynyl.

Verbindungen I werden besonders bevorzugt, in denen  $R^u$  für Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkynyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkenyloxy,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkynyloxy,  $-C(=O)-O-A$ ,  $-C(=O)-N(A')A$ ,  $C(A') (=N-OA)$  steht, wobei die aliphatischen oder alicyclischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können.

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen  $R^u$  für Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkynyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyloxy,  $C_2$ - $C_6$ -Alkynyloxy steht.

Außerdem werden Pyrimidine I bevorzugt, wobei die durch  $L_n$  substituierte Phenylgruppe für die Gruppe B



steht, worin # die Verknüpfungsstelle mit dem Pyrimidin-Gerüst ist und

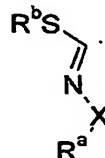
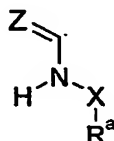
$L^1$  Fluor, Chlor,  $CH_3$  oder  $CF_3$ ;  
 $L^2, L^4$  unabhängig voneinander Wasserstoff,  $CH_3$  oder Fluor;  
 $L^3$  Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano,  $CH_3$ ,  $SCH_3$ ,  $OCH_3$ ,  $SO_2CH_3$ ,  $CO-NH_2$ ,  $CO-NHCH_3$ ,  $CO-NHC_2H_5$ ,  $CO-N(CH_3)_2$ ,  $NH-C(=O)CH_3$ ,  $N(CH_3)-C(=O)CH_3$  oder  $COOCH_3$  und  
 $L^5$  Wasserstoff, Fluor, Chlor oder  $CH_3$  bedeuten.

Besonders bevorzugt werden auch Verbindungen I, in denen  $R^3$   $C_1$ - $C_4$ -Alkyl bedeutet, das durch Halogen substituiert sein kann.

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen  $R^3$  für Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy steht.

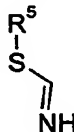
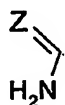
- 5 Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen  $R^3$  Methyl, Cyano, Methoxy oder insbesondere Chlor bedeutet.

Geeignet im Hinblick auf ihre fungizide Wirkung sind Pyrimidine der Formel I, in der  $R^4$  für



- 10 steht.

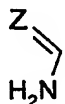
Weiterhin sind Pyrimidine der Formel I bevorzugt, in der  $R^4$  für



steht.

- 15

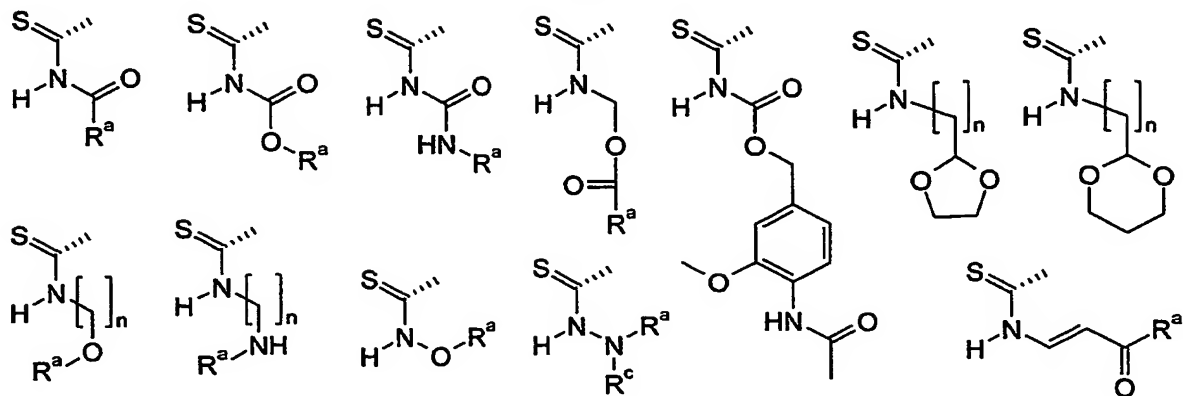
Insbesondere sind Pyrimidine der Formel I bevorzugt, in der  $R^4$  für



steht.

- 20 Schließlich kann  $R^4$  bevorzugt die folgenden Bedeutungen haben, die auch als prodrug-Restedefinitionen aufgefasst werden können (s. Medicininal Research Reviews 2003, 23, 763 – 793, oder J. of Pharmaceutical Sciences 1997, 86, 765-767):

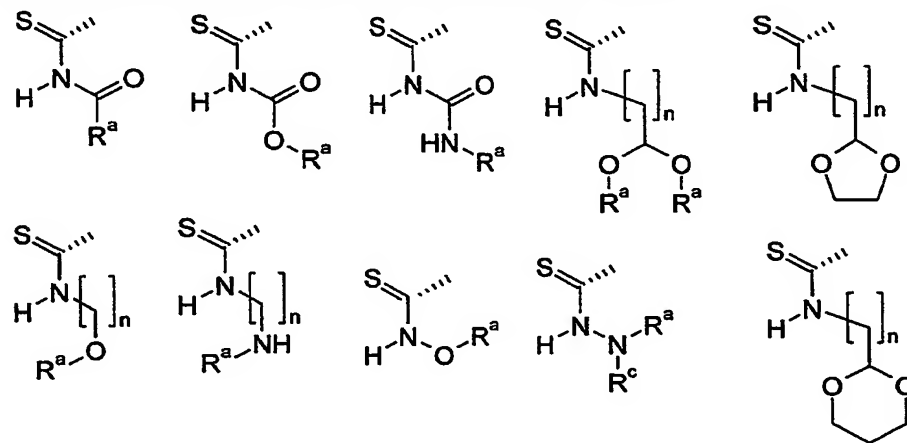
15



Der Index n in den Alkenylenresten der obigen Formeln steht für eine ganze Zahl 1 bis 3.

5

Insbesondere bevorzugt sind die Restdefinitionen R<sup>4</sup>:



Das Brückenglied X steht bevorzugt für eine direkte Bindung und für -(C=O)-.

10 Der Substituent R<sup>a</sup> steht vorzugsweise für Wasserstoff, Methyl, Allyl oder Propargyl und besonders bevorzugt für Wasserstoff.

Der Substituent R<sup>b</sup> bedeutet bevorzugt Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl und insbesondere bevorzugt: Methyl, Allyl oder Propargyl.

15

Der Substituent R<sup>c</sup> bedeutet bevorzugt Wasserstoff oder Methyl.

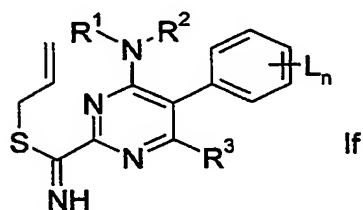
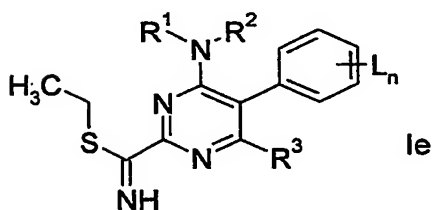
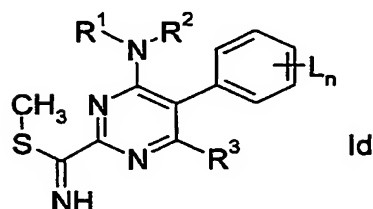
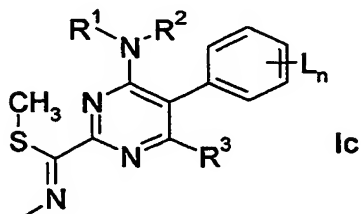
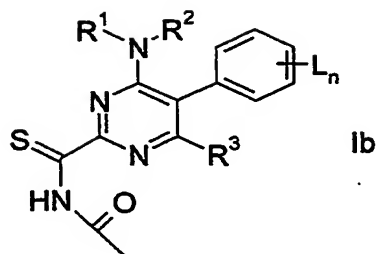
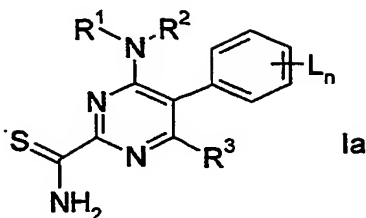


Tabelle 1

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor, 6-chlor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 2

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Difluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 3

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Dichlor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 4

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor, 6-methyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 5

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4,6-Trifluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht



**Tabelle 6**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-fluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

**Tabelle 7**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

**Tabelle 8**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-CN,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15 **Tabelle 9**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4,5-Trifluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 10**

20 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4-Dichlor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 11**

25 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 12**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

**Tabelle 13**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4-Difluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35 **Tabelle 14**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor-4-chlor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 15

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor-4-fluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 16

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,3-Difluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 10 Tabelle 17

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,5-Difluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 18

15 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,3,4-Trifluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 19

20 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 20

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4-Dimethyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 21

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl-4-chlor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 22

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor-4-methyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 23

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Dimethyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

**Tabelle 24**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4,6-Trimethyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**5 Tabelle 25**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-cyano,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**10 Tabelle 26**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-methyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**15 Tabelle 27**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**20 Tabelle 28**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Methoxy,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**25 Tabelle 29**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Methyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**30 Tabelle 30**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**35 Tabelle 31**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Brom,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 32

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor, 4-Cyan,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 33

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Difluor, 4-methoxy,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 34

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor, 3-methyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 15 Tabelle 35

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,5-Dimethyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 36

20 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl, 4-Cyan,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 37

25 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl, 4-brom,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 38

30 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl, 5-fluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 39

35 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl, 4-methoxy,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 40

40 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl, 4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 41

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,5-Dimethyl,4-brom,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 42

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-brom,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 43

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-methoxy,  $R^2$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 44

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,5-methyl,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 45

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  Pentafluor,  $R^3$  Methyl bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 46

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,6-chlor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 47

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Difluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 48

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Dichlor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 49

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,6-methyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

- 5      **Tabelle 50**  
Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4,6-Trifluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
- 10     **Tabelle 51**  
Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-fluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
- 15     **Tabelle 52**  
Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
- 20     **Tabelle 53**  
Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-CN,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
- 25     **Tabelle 54**  
Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4,5-Trifluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
- 30     **Tabelle 55**  
Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4-Dichlor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
- 35     **Tabelle 56**  
Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
- 40     **Tabelle 57**  
Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
- 45     **Tabelle 58**  
Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4-Difluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 59

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor-4-chlor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 60

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor-4-fluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 10 Tabelle 61

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,3-Difluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 62

15 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,5-Difluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 63

20 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,3,4-Trifluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 64

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 65

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4-Dimethyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 30 Tabelle 66

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl-4-chlor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 67

35 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor-4-methyl,  $R^2$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 68

40 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Dimethyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 69

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4,6-Trimethyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 70

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-cyano,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 71

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-methyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 72

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 73

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Methoxy,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 74

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Methyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 75

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Brom,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht



## Tabelle 77

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor, 4-Cyan,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 78

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Difluor, 4-methoxy,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 79

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor, 3-methyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 15 Tabelle 80

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,5-Dimethyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 81

20 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl, 4-cyan,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 82

25 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl, 4-brom,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 83

30 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl, 5-fluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 84

35 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl, 4-methoxy,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 85

40 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl, 4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 86

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,5-Dimethyl,4-brom,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 87

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-brom,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 10 Tabelle 88

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-methoxy,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 15 Tabelle 89

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,5-methyl,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 90

20 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  Pentafluor,  $R^3$  Chlor bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 91

25 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,6-chlor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 92

30 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Difluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 93

35 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Dichlor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 94

40 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,6-methyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 95**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4,6-Trifluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**5    Tabelle 96**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-fluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**10   Tabelle 97**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**15   Tabelle 98**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-CN,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 99**

**20   Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4,5-Trifluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht**

**Tabelle 100**

**25   Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4-Dichlor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht**

**Tabelle 101**

**30   Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht**

**Tabelle 102**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**35   Tabelle 103**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4-Difluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 104**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor-4-chlor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

**Tabelle 105**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor-4-fluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10 **Tabelle 106**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,3-Difluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 107**

15 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,5-Difluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 108**

20 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,3,4-Trifluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 109**

25 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 110**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4-Dimethyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30 **Tabelle 111**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl-4-chlor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35 **Tabelle 112**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor-4-methyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

- Tabelle 113**  
Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Dimethyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
- 5
- Tabelle 114**  
Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4,6-Trimethyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
- 10
- Tabelle 115**  
Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-cyano,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
- 15
- Tabelle 116**  
Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-methyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
- 20
- Tabelle 117**  
Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-Methoxycarbonyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
- 25
- Tabelle 118**  
Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Methoxy,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
- 30
- Tabelle 119**  
Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Methyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
- 35
- Tabelle 120**  
Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 121**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor, 4-Methoxy,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

**Tabelle 122**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor, 4-Cyan,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

**Tabelle 123**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Difluor, 4-methoxy,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

**Tabelle 124**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor, 3-methyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

**Tabelle 125**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,5-Dimethyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

**Tabelle 126**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl, 4-Cyan,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

**Tabelle 127**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl, 4-Brom,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

**Tabelle 128**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl, 5-fluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 129

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-methoxy,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 130

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 131

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,5-Dimethyl,4-brom,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 132

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-brom,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 133

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-methoxy,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 134

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,5-methyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 135

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  Pentafluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 136

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,6-chlor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 137**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Difluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

**Tabelle 138**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Dichlor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10 **Tabelle 139**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,6-methyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 140**

15 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4,6-Trifluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 141**

20 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-fluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 142**

25 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 143**

30 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-CN,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 144**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4,5-Trifluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35 **Tabelle 145**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4-Dichlor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht



**Tabelle 146**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

**Tabelle 147**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10 **Tabelle 148**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4-Difluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 149**

15 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor-4-chlor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 150**

20 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor-4-fluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 151**

25 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,3-Difluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 152**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,5-Difluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30 **Tabelle 153**

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,3,4-Trifluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 154**

35 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**Tabelle 155**

40 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4-Dimethyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 156

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl-4-chlor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 157

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor-4-methyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 10 Tabelle 158

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Dimethyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 159

15 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,4,6-Trimethyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 160

20 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-cyano,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 161

25 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-methyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 162

30 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 163

35 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Methoxy,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 164

40 Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Chlor,4-Methyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 165

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor, 4-methoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 166

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor, 4-Brom, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 167

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen L<sub>n</sub> 2-Chlor, 4-Cyan, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 168

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen L<sub>n</sub> 2,6-Difluor, 4-methoxy, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 169

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen L<sub>n</sub> 2-Fluor, 3-methyl, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 170

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen L<sub>n</sub> 2,5-Dimethyl, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 171

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl, 4-cyan, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 172

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl, 4-brom, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 173

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen L<sub>n</sub> 2-Methyl, 5-fluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 174

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-methoxy,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 175

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Methyl,4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 176

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2,5-Dimethyl,4-brom,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 177

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-brom,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 178

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,4-methoxy,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 179

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  2-Fluor,5-methyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 180

Verbindungen der Formel Ia, Ib, Ic, Id, Ie und If, in denen  $L_n$  Pentafluor,  $R^3$  Cyano bedeuten und  $R^1$ ,  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht


## Tabelle A

35

No.	$R^1$	$R^2$
A-1.	$CH_2CH_3$	H
A-2.	$CH_2CH_3$	$CH_3$
A-3.	$CH_2CH_3$	$CH_2CH_3$
A-4.	$CH_2CH_2CH_3$	H

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-5.	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-6.	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-7.	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-8.	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	H
A-9.	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	CH <sub>3</sub>
A-10.	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-11.	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
A-12.	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-13.	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-14.	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-15.	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	H
A-16.	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-17.	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-18.	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-19.	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-20.	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-21.	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-22.	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-23.	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-24.	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-25.	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-26.	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-27.	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-28.	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-29.	(±) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>	H
A-30.	(±) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-31.	(±) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-32.	® CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>	H
A-33.	® CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-34.	® CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-35.	(S) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>	H
A-36.	(S) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-37.	(S) CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-38.	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-39.	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-40.	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-41.	® CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-42.	® CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-43.	® CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-44.	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-45.	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-46.	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-47.	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-48.	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-49.	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-50.	® CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-51.	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-52.	® CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-53.	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-54.	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-55.	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-56.	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-57.	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-58.	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-59.	® CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-60.	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-61.	® CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-62.	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-63.	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-64.	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-65.	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-66.	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-67.	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-68.	® CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-69.	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-70.	® CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-71.	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-72.	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-73.	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-74.	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H
A-75.	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-76.	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-77.	Cyclopentyl	H
A-78.	Cyclopentyl	CH <sub>3</sub>

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-79.	Cyclopentyl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-80.	Cyclohexyl	H
A-81.	Cyclohexyl	CH <sub>3</sub>
A-82.	Cyclohexyl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-83.	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	
A-84.	(±) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-85.	(R) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-86.	(S) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-87.	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-88.	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-89.	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]-CH <sub>2</sub> -	
A-90.	(±) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-	
A-91.	(±) -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-	
A-92.	-CH <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub> -	
A-93.	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	
A-94.	(±) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-	
A-95.	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-96.	(±) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-97.	(R) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-98.	(S) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -	
A-99.	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(O[CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-100.	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  -CH <sub>2</sub>	
A-101.	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(O[CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-102.	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub> -	

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der Ascomyceten, Deuteromyceten, Oomyceten und Basidiomyceten. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
- *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- 5 • *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,
- 10 • *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- *Plasmopara viticola* an Reben,
- *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- 15 • *Puccinia*-Arten an Getreide,
- *Pyricularia oryzae* an Reis,
- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
- *Uncinula necator* an Reben,
- 20 • *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Bimen.

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Pae-*  
*cilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich,  
 25 Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu  
 schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid  
 wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch  
 30 nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwi-  
 schen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

35 Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des  
 gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis  
 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.



Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Aufwandsmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

5

Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

10

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiernmitteln. Als Lösungsmittel / Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht:

15

- Wasser, aromatische Lösungsmittel (z.B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol, Pentanol, Benzylalkohol), Ketone (z.B. Cyclohexanon, gamma-Butyrolacton), Pyrrolidone (NMP, NOP), Acetate (Glykoldiacetat), Glykole, Dimethylfettsäureamide, Fettsäuren und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden,

20

- Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiernmittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

25

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykoether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykoether, Tributylphenylpolyglykoether, Tristerylphenylpolyglykoether, Alkylarylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoetheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

30

35

40

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

10    Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Beispiele für Formulierungen sind:      1. Produkte zur Verdünnung in Wasser

30    A)    Wasserlösliche Konzentrate (SL)

10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Wasser oder einem wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Alternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt. Bei der Verdünnung in Wasser löst sich der Wirkstoff.

35    B)    Dispergierbare Konzentrate (DC)

20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Cyclohexanon unter Zusatz eines Dispergiermittels z.B. Polyvinylpyrrolidon gelöst. Bei Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Dispersion.

40

- C) Emulgierbare Konzentrate (EC)
- 5 15 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.
- D) Emulsionen (EW, EO)
- 10 40 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Diese Mischung wird mittels einer Emulgiermaschine (Ultraturax) in Wasser eingebracht und zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.
- 15 E) Suspensionen (SC, OD)
- 20 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln und Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoffsuspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs.
- 25 F) Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG)
- 30 50 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z.B. Extrusion, Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.
- G) Wasserdispergierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP)
- 35 75 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator Mühle vermahlen. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.
2. Produkte für die Direktapplikation
- 40

## H) Stäube (DP)

- 5            5 Gew.Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95 % feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält dadurch ein Stäubemittel.

## I) Granulate (GR, FG, GG, MG)

- 10           0.5 Gew-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95.5 % Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation.

## 15    J) ULV- Lösungen (UL)

- 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einem organischen Lösungsmittel z.B. Xylol gelöst. Dadurch erhält man ein Produkt für die Direktapplikation.

20

- Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder  
25    Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

- 30           Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereit werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und  
35    eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

- 40           Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

5

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Netzmittel, Adjuvants, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

10

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

15

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

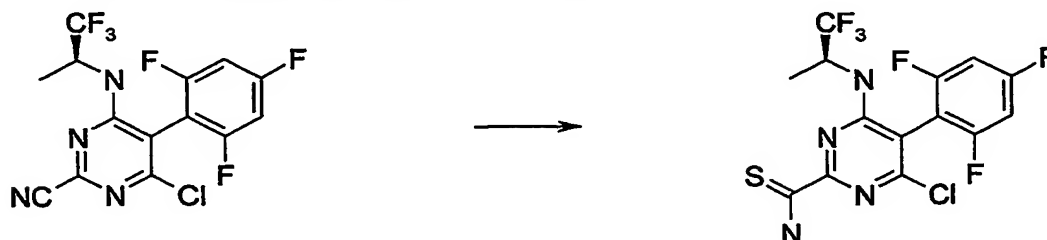
20

- Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,
- 25 • Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph
- Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyrodinyl,
- 30 • Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder Streptomycin,
- Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenoconazole, Dinitroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Flutriafol, Hexaconazol, Imazalil, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, 35 Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
- Dicarboximide wie Iprodion, Myclobutin, Procymidon, Vinclozolin,

- Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,
- 5 • Heterocyclische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon, Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuarimol, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenox, Pyroquilon, Quinoxifen, Silthiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine,
- 10 • Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
- Nitrophenylderivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl
- 15 • Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
- Schwefel
- 20 • Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthiavalicarb, Carpropamid, Chlorothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Diclomezin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil, Ferimzone, Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Tolclofos-methyl, Quintozene, Zoxamid
- 25 • Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
- Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid
- 30 • Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.

## Synthesebeispiele

Beispiel 1: Synthese von (S)-4-Chloro-6-(2,2,2-trifluoro-1-methyl-ethylamino)-5-(2,4,6-trifluoro-phenyl)-pyrimidin-2-thiocarbamid



5

In eine Lösung von 0.5 g (1.35 mmol) (S)-4-Chloro-6-(2,2,2-trifluoro-1-methylethylamino)-5-(2,4,6-trifluoro-phenyl)-pyrimidin-2-carbonitril, das nach WO 03/043993 hergestellt wurde, in 0.16 g Triethylamin und 6 ml N-Methylpyrrolidon wurde bei Raumtemperatur 5 Minuten lang Schwefelwasserstoff eingeleitet. Nach beendeter Reaktion wurde 20 ml Wasser zugesetzt, die Mischung mit Essigsäure neutralisiert, mit Methyl-tert.-butylether extrahiert, die organische Phase mit Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt.

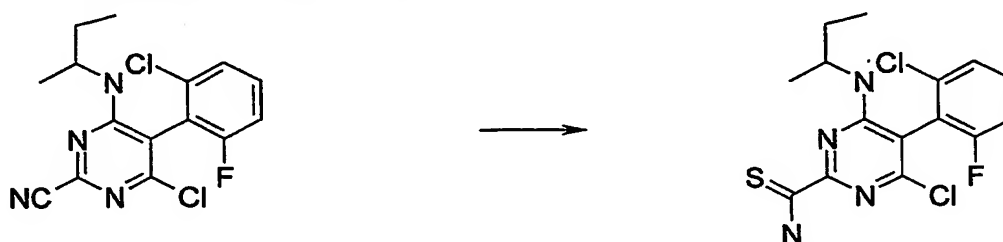
10

Ausbeute: 0.44 g (81 % der Theorie)

Fp.: 101-103°C

15

Beispiel 2: Synthese von 4-sec-Butylamino-6-chloro-5-(2-chloro-6-fluoro-phenyl)-pyrimidin-2-thiocarbamid



20

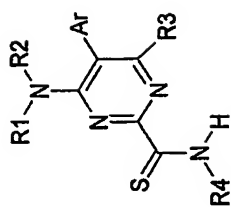
In eine Lösung von 1.0 g (2.9 mmol) 4-sec-Butylamino-6-chloro-5-(2-chloro-6-fluoro-phenyl)-pyrimidin-2-carbonitril in 0.36 g Triethylamin und 12 ml N-Methylpyrrolidon wurde bei Raumtemperatur 5 Minuten lang Schwefelwasserstoff eingeleitet. Nach beendeter Reaktion wurde 20 ml Wasser zugesetzt, die Mischung mit Essigsäure neutralisiert, mit Methyl-tert.-butylether extrahiert, die organische Phase mit Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt.

25

Ausbeute: 0.57 g (53 % der Theorie)

Fp.: 147-150°C

Die in der folgenden Tabelle aufgeführten Verbindungen wurden analog zu den oben-erwähnten Vorschriften synthetisiert.



Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Ar	Fp.: [°C]	<sup>1</sup> H-NMR (ppm, CHCl <sub>3</sub> )
I-1	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Cl	H	2-Chlor-6-fluorophenyl	170-172	
I-2	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CF <sub>3</sub>	H	Cl	H	2,4,6-Trifluorophenyl	101-103	
I-3	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	Cl	H	2-Chlor-6-fluorophenyl		1.21 (d, 6H); 4.42 (m, br, 2H); 7.21 (t, 1H); 7.36 (m, 2H); 8.03 (s, br, 1H); 9.12 (s, br, 1H)
I-4	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	Cl	H	2,4,6-Trifluorophenyl	145-149	
I-5	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	Cl	H	2,4,6-Trifluorophenyl	110-113	
I-6	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )	H	Cl	H	2,4,6-Trifluorophenyl		1.27 (d, 3H); 1.6 (m, 4H); 3.92 (m, 2H); 4.48 (m, 1H); 6.76 (m, 2H); 7.80 (s, br, 1H); 9.04 (s, br, 1H)
I-7	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	H	2,4,6-Trifluorophenyl	130-132	



Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Ar	Fp.: [°C]	<sup>1</sup> H-NMR (ppm, CHCl <sub>3</sub> )
I-8	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>3</sub>	H	Cl	H	2-Chlor-6-fluorophenyl	147-150	
I-9	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	H	2-Chlor-6-fluorophenyl		1.03 (m, 3H); 1.45 (s, 3H); 3.24 (m, 1H); 3.50 (m, 1H); 3.83 (m, 2H); 4.79 (s, 2H); 7.10 (m, 1H); 7.36 (m, 2H); 8.00 (s, br, 1H); 9.05 (s, br, 1H)
I-10	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	Cl	H	2-Chlor-6-fluorophenyl		0.88 (dd, 6H); 1.20 (dd, 3H); 1.79 (m, 1H); 4.45 (m, br, 2H); 7.20 (m, 1H); 7.43 (m, 2H); 7.70 (s, br, 1H); 9.06 (s, br, 1H)
I-11	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	Cl	H	2-Chlor-4-fluorophenyl		0.85 (dd, 6H); 1.15 (dd, 3H); 1.75 (m, 1H); 4.40 (m, br, 2H); 7.19 (m, 1H); 7.33 (m, 2H); 8.03 (s, br, 1H); 9.11 (s, br, 1H)
I-12	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	Cl	H	2,4-Difluorophenyl		0.84 (dd, 6H); 1.16 (dd, 3H); 1.78 (m, 1H); 4.30 (m, br, 2H); 7.00 (m, 1H); 7.08 (m, 1H); 7.38 (m, 1H); 8.0 (s, br, 1H); 9.0 (s, br, 1H)
I-13	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	Cl	H	2,4,6-Trifluorophenyl	54-60	
I-14	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CF <sub>3</sub>	H	Cl	H	2-Chlor-6-fluorophenyl	120-123	
I-15	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	Cl	H	2,4,6-Trifluorophenyl	142-145	
I-16	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		Cl	H	2,4,6-	66-69	

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Ar	Fp.: [°C]	<sup>1</sup> H-NMR (ppm, CHCl <sub>3</sub> )
I-17	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CF <sub>3</sub>	H	Cl	COCH <sub>3</sub>	Trifluorophenyl	55-58	
I-18	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CF <sub>3</sub>	H	Cl	H	2-Chlor-4-fluorophenyl		1,34 (m, 3H); 4,4 (d, 1H); 4,94 (m, 1H); 7,19 (m, 1H); 7,31 (m, 2H); 8,31 (s, 1H); 8,92 (s, 1H); 11,61 (s, 1H)
I-19	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	H	2,4,6-Trifluorophenyl		1,03 (m, 6H); 3,37 (m, 4H); 6,8 (m, 2H); 8,03 (m, 1H); 9,02 (m, 1H)
I-20	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	Cl	H	2-Chlor-4-fluorophenyl		0,85 (m, 6H); 1,1 (m, 3H); 1,7 (m, 1H); 4,03 (s, 1H); 4,35 (d, 1H); 7,17 (m, 1H); 7,33 (m, 2H); 7,7 (s, 1H); 8,86 (s, 1H); 11,39 (s, 1H)
I-21	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	COCH <sub>3</sub>	2,4,6-Trifluorophenyl		1,07 (m, 6H); 2,65 (s, 3H); 3,37 (m, 4H); 6,83 (t, 2H); 11,62 (s, 1H)
I-22	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	Cl	H	2-Chlor-4-fluorophenyl	172-175	
I-23	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	Me	H	2,4,6-Trifluorophenyl	158	
I-24	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	Me	H	2,4,6-Trifluorophenyl	114-117	
I-25	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		Me	H	2,4,6-Trifluorophenyl	149-151	

## Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

5

Die Wirkstoffe wurden getrennt als Stammlösung formuliert mit 0,25 Gew.-% Wirkstoff in Aceton oder DMSO angesetzt. Dieser Lösung wurde 1 Gew.-% Emulgator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) zugesetzt. Die Stammlösungen der Wirkstoffe wurden entsprechend der angegebenen

10

Konzentration mit Wasser verdünnt.

## Anwendungsbeispiele

- 1) Wirksamkeit gegen den Grauschimmel an Paprikablättern verursacht durch *Botrytis cinerea* bei protektiver Anwendung

15

Paprikasämlinge der Sorte "Neusiedler Ideal Elite" wurden, nachdem sich 4 - 5 Blätter gut entwickelt hatten, mit einer wässrigen Suspension in einer Wirkstoffkonzentration von 250 ppm bis zur Tropfnässe besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Botrytis cinerea*, die  $1.7 \times 10^6$  Sporen/ml in einer 2 %igen wässrigen Biomazlösung enthielt, inokuliert. Anschließend wurden die Versuchspflanzen in eine Klimakammer mit 22 bis 24°C und hoher Luftfeuchtigkeit gestellt. Nach 5 Tagen konnte das Ausmaß des Pilzbefalls auf den Blättern visuell in % ermittelt werden.

20

- 25 Bei diesem Versuch zeigten die mit Verbindungen I-2, I-3, I-4, I-6, I-7, I-8, I-10 und I-11 behandelten Pflanzen keinen Befall während die unbehandelten Pflanzen zu 90% befallen waren.

25

- 2) Wirksamkeit gegen Mehltau an Gurkenblättern verursacht durch *Sphaerotheca fuliginea* bei protektiver Anwendung

30

Blätter von in Töpfen gewachsenen Gurkenkeimlingen der Sorte "Chinesische Schlange" wurden im Keimblattstadium mit wässriger Suspension in einer Wirkstoffkonzentration von 250 ppm bis zur Tropfnässe besprüht. 20 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension des Gurkenmehltaus (*Sphaerotheca fuliginea*) inokuliert. Anschließend wurden die Pflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 24°C und 60 bis 80 % relativer Luftfeuchtigkeit für 7 Tage kultiviert. Dann wurde das Ausmaß der Mehltauentwicklung visuell in %-Befall der Keimblattfläche ermittelt.

35

40

Bei diesem Versuch zeigten die mit Verbindungen I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10 und I-11 behandelten Pflanzen keinen oder einen Befall unter 10% während die unbehandelten Pflanzen zu 100% befallen waren.

5     3.     Wirksamkeit gegen die Dürffleckenkrankheit der Tomate verursacht durch  
              *Altanaria solani*

Blätter von Topfpflanzen der Sorte „Goldene Prinzessin“ wurden mit einer wässrigen Suspension in einer Wirkstoffkonzentration von 250 ppm bis zur Tropfnässe besprüht.  
10    Am folgenden Tag wurden die Blätter mit einer wässrigen Sporenaufschwemmung von *Alternaria solani* in 2 % Biomalzlösung mit einer Dichte von  $0.17 \times 10^6$  Sporen/ml infiziert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 20 und 22°C aufgestellt. Nach 5 Tagen hatte sich die Krankheit auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt,  
15    dass der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.

Bei diesem Versuch zeigten die mit Verbindungen I-13, I-14, I-15, I-16, I-17 und I-19 behandelten Pflanzen einen Befall <5 % während die unbehandelten Pflanzen zu 80 % befallen waren.

20

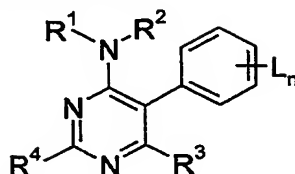
4.     Wirksamkeit gegen die Netzfleckenkrankheit der Gerste verursacht durch  
              *Pyrenophora teres*.

Blätter von in Töpfen gewachsenen Gerstenkeimlingen der Sorte „Hanna“ wurden mit wässriger Sspension in einer Wirkstoffkonzentration von 250 ppm bis zur Tropfnässe besprüht. 24 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Versuchspflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension von *Pyrenophora [syn. Drechslera] teres*, dem Erreger der Netzfleckenkrankheit inokuliert. Anschließend wurden die Versuchspflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 24°C und 95 bis  
25    100 % relativer Luftfeuchte aufgestellt. Nach 6 Tagen wurde das Ausmaß der Krankheitsentwicklung visuell in % Befall der gesamten Blattfläche ermittelt.  
30

Bei diesem Versuch zeigten die mit Verbindungen I-13, I-14, I-15, I-16, I-17 und I-19 behandelten Pflanzen einen Befall <10 % während die unbehandelten Pflanzen zu 80 % befallen waren.  
35

## Patentansprüche

## 1. 2-Substituierte Pyrimidine der Formel I



I

5 in der der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

n eine ganze Zahl von 1 bis 5;

10 L Halogen, Cyano, Cyanato (OCN), C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkynyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyloxy, C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyloxy, Nitro, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')(=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)<sub>m</sub>-A, S(=O)<sub>m</sub>-O-A oder S(=O)<sub>m</sub>-N(A')A,

15 m 0, 1 oder 2;

20 A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, Phenyl, wobei die organischen Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder durch Nitro, Cyanato, Cyano oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiert sein können; oder A und A' zusammen mit den Atomen an die sie gebunden sind für einen fünf- bis sechsgliedrigen gesättigten, partiell ungesättigten oder aromatischen Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, stehen;

25 wobei die aliphatischen Gruppen der Restdefinitionen von L ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis vier Gruppen R<sup>u</sup> tragen können:

30 R<sup>u</sup> Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkynyloxy, C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyloxy, C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyloxy, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')(=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)<sub>m</sub>-A, S(=O)<sub>m</sub>-O-A oder S(=O)<sub>m</sub>-N(A')A;

35

$R^1, R^2$  unabhängig voneinander  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkynyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Halogenycycloalkyl, wobei die aliphatischen Gruppen der Restdefinitionen von  $R^1$  und  $R^2$  ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis vier Gruppen  $R^v$  tragen können:

5

$R^v$  Cyano,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_4$ - $C_6$ -Cycloalkenyl, Hydroxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_8$ -Alkenyloxy,  $C_2$ - $C_8$ -Alkinyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyloxy,  $C_4$ - $C_6$ -Cycloalkenyloxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $-C(=O)-A$ ,  $-C(=O)-O-A$ ,  $-C(=O)-N(A')A$ ,  $C(A') (=N-OA)$ ,  $N(A')A$ ,  $N(A')-C(=O)-A$ ,  $N(A'')-C(=O)-N(A')A$ ,  $S(=O)_m-A$ ,  $S(=O)_m-O-A$  oder  $S(=O)_m-N(A')A$  oder Phenyl, wobei der Phenylteil ein bis drei Reste ausgewählt aus der Gruppe: Halogen,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkynyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy, Cyano, Nitro,  $-C(=O)-A$ ,  $-C(=O)-O-A$ ,  $-C(=O)-N(A')A$ ,  $C(A') (=N-OA)$ ,  $N(A')A$  tragen kann;

10

15

$R^2$  kann zusätzlich Wasserstoff bedeuten;

20

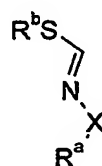
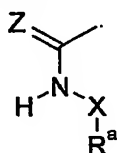
$R^1$  und  $R^2$  können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch eine Ether  $-(O-)$ , Carbonyl  $-(C=O)-$ , Thio  $-(S-)$ , Sulfoxyl  $-(S[=O]-)$  oder Sulfenyl  $-(SO_2-)$  oder eine weitere Amino  $-(N(R^a)-)$  Gruppe, wobei  $R^a$  Wasserstoff oder  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl bedeutet, unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl und Oxy- $C_1$ - $C_3$ -alkylenoxy enthalten kann;

25

30

$R^3$  Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_4$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_4$ -Alkynyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_3$ - $C_4$ -Alkenyloxy,  $C_3$ - $C_4$ -Alkinyloxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio, Di- $(C_1$ - $C_6$ -alkyl)amino oder  $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino, wobei die Alkyl, Alkenyl und Alkynylreste von  $R^3$  durch Halogen, Cyano, Nitro,  $C_1$ - $C_2$ -Alkoxy oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy-carbonyl substituiert sein können;

$R^4$  einer der Formeln



35

entspricht, in denen

## 55

X eine direkte Bindung,  $-(C=O)-$ ,  $-(C=O)-NH-$ ,  $-(C=O)-O-$ ,  $-O-$ ,  $-NR^c$ , wobei der jeweils linke Molekülteil an das Stickstoffatom gebunden ist;

5  $R^a$  Wasserstoff, Methyl, Benzyl, Trifluormethyl, Allyl, Propargyl oder Methoxymethyl;

$R^b$  Wasserstoff,  $C_1-C_6$ -Alkyl,  $C_2-C_6$ -Alkinyl;

10  $R^c$  Wasserstoff, Methyl oder  $C_1-C_4$ -Acyl

Z S oder  $NR^b$ ;

bedeuten,

15 wobei die aliphatischen Gruppen der Restdefinitionen von  $R^a$ ,  $R^b$  und/oder  $R^c$  ihrerseits eine oder zwei Gruppen  $R^w$  tragen können:

$R^w$  Halogen,  $OR^x$ ,  $NHR^x$ ,  $C_1-C_6$ -Alkyl,  $C_1-C_4$ -Alkoxycarbonyl,  $C_1-C_4$ -Acylamino, [1,3]Dioxolane- $C_1-C_4$ -alkyl, [1,3]Dioxane- $C_1-C_4$ -alkyl, wo-

20 bei

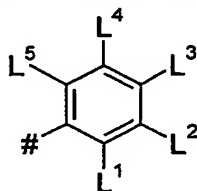
$R^x$  Wasserstoff, Methyl, Allyl oder Propargyl bedeutet.

25

2. 2-Substituierte Pyrimidine nach Anspruch 1, wobei  $R^3$  Chlor, Cyano, Methyl oder Methoxy bedeutet.

30 3. 2-Substituierte Pyrimidine nach Anspruch 1, wobei  $R^a$  Wasserstoff und  $R^5$  Wasserstoff,  $C_1-C_6$ -Alkyl oder  $C_2-C_6$ -Alkenyl bedeuten.

4. 2-Substituierte Pyrimidine nach einem der Ansprüche 1 bis 3, in der die durch  $L_n$  substituierte Phenylgruppe für die Gruppe B



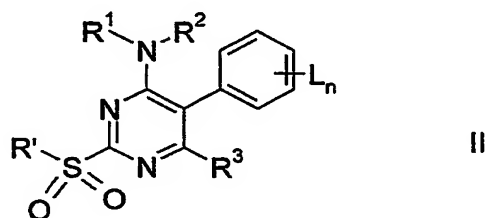
B

35

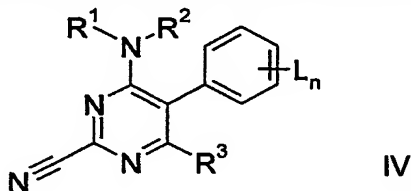
steht, worin # die Verknüpfungsstelle mit dem Pyrimidin-Gerüst ist und

- $L^1$  Fluor, Chlor,  $CH_3$  oder  $CF_3$ ;  
 $L^2, L^4$  unabhängig voneinander Wasserstoff,  $CH_3$  oder Fluor;  
 $L^3$  Wasserstoff, Fluor, Chlor, Cyano,  $CH_3$ ,  $SCH_3$ ,  $OCH_3$ ,  $SO_2CH_3$ ,  $NH-C(=O)CH_3$ ,  $N(CH_3)-C(=O)CH_3$  oder  $COOCH_3$  und  
 $L^5$  Wasserstoff, Fluor, Chlor oder  $CH_3$  bedeuten.

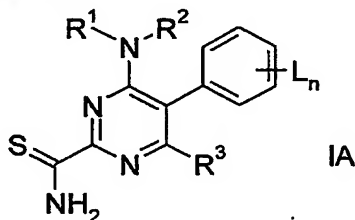
5. Verfahren zur Herstellung von 2-substituierten Pyrimidinen der Formel I gemäß Anspruch 1, wobei  $R^4$  für ein Thioamid steht, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel II,



in der die Substituenten  $L$ ,  $R^1$ ,  $R^2$  und  $R^3$  die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben und  $R'$  für einen ggf. substituierten  $C_1$ - $C_6$ -Alkylrest oder einen ggf. subst. Phenylrest steht, mit einem Alkalimetall-, Erdalkalimetall- oder Zinncyanid der Formel (III), umgesetzt und anschließend die erhaltene Verbindung IV



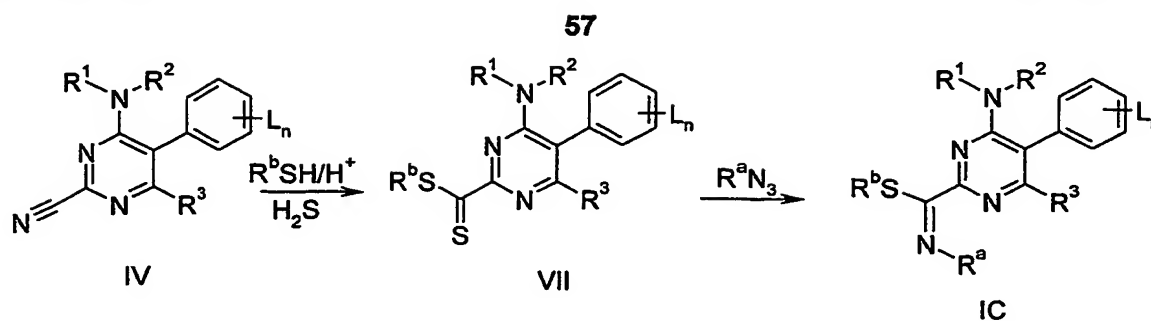
mit Schwefelwasserstoff zu IA



umsetzt.

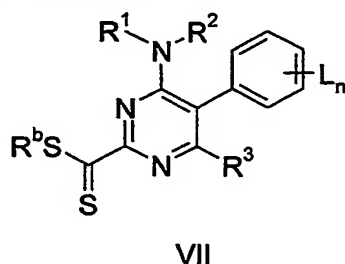
6. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel IC, wobei die Substituenten  $L_n$ ,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^a$  und  $R^b$ , wie in Anspruch 1 definiert sind





5 ausgehend von Nitril IV durch Umsetzung mit Merkaptanen der Formel  $\text{R}^b\text{SH}$  unter sauren Bedingungen und weiterer Umsetzung des erhaltenen Dithiocarbonsäureesters der Formel VII mit Aziden der Formel  $\text{R}^a\text{N}_3$ .

7. Verbindungen der Formel VII,



10 wobei die Substituenten  $\text{R}^1$ ,  $\text{R}^2$ ,  $\text{R}^3$ ,  $\text{R}^b$  und  $\text{L}_n$  die in Anspruch 1 gegebene Bedeutung haben.

8. Zur Bekämpfung von Schadpilzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1.

15 9. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP2004/007258

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
IPC 7 C07D239/42

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, PAJ, WPI Data

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 03/043993 A (GRAMMENOS WASSILIOS ; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 30 May 2003 (2003-05-30) cited in the application page 1, line 4 - line 5 Seite 1, Formel I page 2, line 45 page 17, line 36 - page 19, line 4 Seite 30 - 50, Beispiele	1-9
A	WO 02/074753 A (RHEINHEIMER JOACHIM ; BASF AG (DE); GEWEHR MARKUS (DE); LORENZ GISELA) 26 September 2002 (2002-09-26) cited in the application page 1, line 2 - line 3 Seite 1, Formel I page 24, line 14 - page 25, line 9 Seite 35 - 44, Beispiele	1-9

☐ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

### \* Special categories of cited documents :

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \*Z\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

15 November 2004

Date of mailing of the international search report

23/11/2004

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Hoepfner, W

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

EP2004/007258

## Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:  
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
  
2. ☐ Claims Nos.:  
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
  
3. ☐ Claims Nos.:  
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

## Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

**see supplemental sheet**

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☒ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
  
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.  
☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

The International Searching Authority has determined that this international application contains multiple (groups of) inventions, namely

1. Claims 1-9 (in part)

provision of pyrimidines substituted in the 2 position with a  
-C(=Z)-NH-X-Ra group wherein Z signifies nitrogen.

---

2. Claims 1-9 (in part)

provision of pyrimidines substituted in the 2 position with a  
-C(=Z)-NH-X-Ra group or a -C(=N-X-Ra)-SRb group wherein  
Z signifies sulfur.

---

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP2004/007258

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 03043993	A	30-05-2003	CA 2467683 A1 WO 03043993 A1 EP 1448532 A1	30-05-2003 30-05-2003 25-08-2004
WO 02074753	A	26-09-2002	BG 108174 A BR 0207975 A CA 2440405 A1 CZ 20032475 A3 EE 200300448 A WO 02074753 A2 EP 1373222 A2 HU 0400210 A2 JP 2004525133 T SK 11422003 A3 US 2004116429 A1	30-09-2004 15-06-2004 26-09-2002 17-12-2003 16-02-2004 26-09-2002 02-01-2004 30-08-2004 19-08-2004 06-04-2004 17-06-2004

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/007258

## A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 C07D239/42

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, PAJ, WPI Data

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 03/043993 A (GRAMMENOS WASSILIOS ; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 30. Mai 2003 (2003-05-30) in der Anmeldung erwähnt Seite 1, Zeile 4 - Zeile 5 Seite 1, Formel I Seite 2, Zeile 45 Seite 17, Zeile 36 - Seite 19, Zeile 4 Seite 30 - 50, Beispiele	1-9
A	WO 02/074753 A (RHEINHEIMER JOACHIM ; BASF AG (DE); GEWEHR MARKUS (DE); LORENZ GISELA) 26. September 2002 (2002-09-26) in der Anmeldung erwähnt Seite 1, Zeile 2 - Zeile 3 Seite 1, Formel I Seite 24, Zeile 14 - Seite 25, Zeile 9 Seite 35 - 44, Beispiele	1-9



Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen



Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

\*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

\*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

\*L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

\*O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

\*P\* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

\*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

\*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

\*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

\*Z\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

15. November 2004

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

23/11/2004

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Hoepfner, W

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

internationales Aktenzeichen  
PCT/EP2004/007258

## Feld II Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1. ☐ Ansprüche Nr.  
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich
2. ☐ Ansprüche Nr.  
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
3. ☐ Ansprüche Nr.  
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

## Feld III Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

siehe Zusatzblatt

1. ☐ Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
2. ☒ Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchegebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
3. ☐ Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
4. ☐ Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

- ☐ Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.
- ☐ Die Zahlung zusätzlicher Recherchegebühren erfolgte ohne Widerspruch.

## WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, dass diese internationale Anmeldung mehrere (Gruppen von) Erfindungen enthält, nämlich:

1. Ansprüche: 1-9 (teilweise)

Bereitstellung von in 2-Stellung mit einer Gruppe  
-C(=Z)-NH-X-Ra substituierten Pyrimidinen, wobei Z die  
Bedeutung "Stickstoff" hat.  
---

2. Ansprüche: 1-9 (teilweise)

Bereitstellung von in 2-Stellung mit einer Gruppe  
-C(=Z)-NH-X-Ra oder -C(=N-X-Ra)-SRb substituierten  
Pyrimidinen, wobei Z die Bedeutung "Schwefel" hat.  
---



# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/007258

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
WO 03043993	A	30-05-2003	CA	2467683 A1	30-05-2003
			WO	03043993 A1	30-05-2003
			EP	1448532 A1	25-08-2004
WO 02074753	A	26-09-2002	BG	108174 A	30-09-2004
			BR	0207975 A	15-06-2004
			CA	2440405 A1	26-09-2002
			CZ	20032475 A3	17-12-2003
			EE	200300448 A	16-02-2004
			WO	02074753 A2	26-09-2002
			EP	1373222 A2	02-01-2004
			HU	0400210 A2	30-08-2004
			JP	2004525133 T	19-08-2004
			SK	11422003 A3	06-04-2004
			US	2004116429 A1	17-06-2004